

- For more records, click the Records link at page end.
- To change the format of selected records, select format and click Display Selected.
- To print/save clean copies of selected records from browser click Print/Save Selected.
- To have records sent as hardcopy or via email, click Send Results.

☒ Select All
☒ Clear Selections

Print/Save Selected

Send Results

Display Selected

Format

Free

1. ☐ 2/5/1 DIALOG(R)File 352:Derwent WPI (c) 2005 Thomson Derwent. All rts. reserv.

009855607 **Image available**

WPI Acc No: 1994-135463/199416

XRAM Acc No: C94-062650

New hydroxyalkyl amide derivs. of dicarboxylic acids - are
 pseudo-ceramide cpds. useful as components in cosmetic compsns.

Patent Assignee: QUEST INT BV (UNIL)

Inventor: JANOUSEK A; MOTION K R; WATKINS S; WATKINS S D

Number of Countries: 046 Number of Patents: 013

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
WO 9407844	A1	19940414	WO 93GB2061	A	19931004	199416 B
AU 9348326	A	19940426	AU 9348326	A	19931004	199432
ZA 9307455	A	19950628	ZA 937455	A	19931007	199531
EP 664790	A1	19950802	EP 93921051	A	19931004	199535
			WO 93GB2061	A	19931004	
JP 8502058	W	19960305	WO 93GB2061	A	19931004	199644
			JP 94508864	A	19931004	
US 5656668	A	19970812	WO 93GB2061	A	19931004	199738
			US 95416719	A	19950530	
EP 664790	B1	19980408	EP 93921051	A	19931004	199818
			WO 93GB2061	A	19931004	
AU 688737	B	19980319	AU 9348326	A	19931004	199825
DE 69317896	E	19980514	DE 617896	A	19931004	199825
			EP 93921051	A	19931004	
			WO 93GB2061	A	19931004	
ES 2114068	T3	19980516	EP 93921051	A	19931004	199826
BR 9307197	A	19990330	BR 937197	A	19931004	199919
			WO 93GB2061	A	19931004	
JP 2908026	B2	19990621	WO 93GB2061	A	19931004	199930
			JP 94508864	A	19931004	
CA 2144452	C	19991228	CA 2144452	A	19931004	200021
			WO 93GB2061	A	19931004	

Priority Applications (No Type Date): EP 93307620 A 19930927; EP 92309140 A 19921007

Cited Patents: 01Jnl.Ref: DE 2604554; EP 420722; EP 450527; EP 482860

Patent Details:

Patent No	Kind	Lan	Pg	Main IPC	Filing Notes
WO 9407844	A1	E	29	C07C-233/18	

Designated States (National): AT AU BB BG BR BY CA CH CZ DE DK ES FI GB HU JP KP KR KZ LK LU MG MN MW NL NO NZ PL PT RO RU SD SE SK UA US VN

Designated States (Regional): AT BE CH DE DK ES FR GB GR IE IT LU MC NL OA PT SE

CA 2144452	C	E		C07C-233/18	Based on patent WO 9407844
AU 9348326	A			C07C-233/18	Based on patent WO 9407844
ZA 9307455	A		26	A61K-000/00	
EP 664790	A1	E		C07C-233/18	Based on patent WO 9407844
				Designated States (Regional): AT	BE CH DE DK ES FR GB GR IT LI NL SE
JP 8502058	W		25	C07C-233/18	Based on patent WO 9407844
US 5656668	A		9	A61K-031/195	Based on patent WO 9407844
EP 664790	B1	E	18	C07C-233/18	Based on patent WO 9407844
				Designated States (Regional): AT	BE CH DE DK ES FR GB IT LI NL SE
AU 688737	B			C07C-233/18	Previous Publ. patent AU 9348326

BEST AVAILABLE COPY

DE 69317896	E	C07C-233/18	Based on patent WO 9407844
			Based on patent EP 664790
			Based on patent WO 9407844
ES 2114068	T3	C07C-233/18	Based on patent EP 664790
BR 9307197	A	C07C-233/18	Based on patent WO 9407844
JP 2908026	B2	13 C07C-233/18	Previous Publ. patent JP 8502058
			Based on patent WO 9407844

Abstract (Basic): WO 9407844 A

Hydroxyalkyl amides of dicarboxylic acids of formula (I) are new.
 R1 = hydrocarbon gp.; R2-R8 = H or CH3; R9, R10 = H or upto 24C
 hydrocarbon gp.; X1, X2 = H or OH; Y1, Y2 = H or OH, at least one of Y1
 or Y2 = OH; C atom Z, associated with R9, R10 may be absent; and C
 atoms W, associated with R7, Y2 may also be absent.

Pref. R1 = 10-24C (esp. 16-18C) aliphatic gp.

USE/ADVANTAGE - The pseudoceramides (I) are useful as components in
 cosmetic compsns. suitable for topical application to skin, hair or
 nails. The compounds are also useful as agents for skin water barrier
 repair, for improving nails and/or improving hair. Cpd. (I) have
 certain properties similar to naturally occurring skin ceramides. The
 cosmetic compsns. comprise 0.0001-50 (esp. 0.001-20, more esp. 0.1-10)
 wt.% of cpd. (I). Cpd. (I) have excellent emulsifying, gelling and
 thickening properties and are well suited to use in formulations in the
 form of viscous emulsions or gels.

Dwg. 0/9

Title Terms: NEW; HYDROXYALKYL; AMIDE; DERIVATIVE; DI; CARBOXYLIC; ACID;
 PSEUDO; CERAMIDE; COMPOUND; USEFUL; COMPONENT; COSMETIC; COMPOSITION

Derwent Class: D21; E16

International Patent Class (Main): A61K-000/00; A61K-031/195; C07C-233/18

International Patent Class (Additional): A61K-007/00; A61K-007/40;
 A61K-007/48; C07C-229/24; C07C-233/56

File Segment: CPI

Derwent WPI (Dialog® File 352): (c) 2005 Thomson Derwent. All rights reserved.

☒ Select All
☒ Clear Selections

Print/Save Selected

Send Results

Display Selected

Format

Free

© 2005 Dialog, a Thomson business

(11)特許出願公表番号

特表平8-502058

(43)公表日 平成8年(1996)3月5日

(51)Int.Cl.⁸

C 0 7 C 233/18

A 6 1 K 7/00

7/48

識別記号

室内整理番号

9547-4H

C 7602-4 C

9271-4C

FI

審查請求 有 予備審查請求 有 (全 25 頁)

(21)出願番号	特願平6-508864
(86)(22)出願日	平成5年(1993)10月4日
(85)翻訳文提出日	平成7年(1995)4月6日
(86)国際出願番号	PCT/GB93/02061
(87)国際公開番号	WO94/07844
(87)国際公開日	平成6年(1994)4月14日
(31)優先権主張番号	92309140.9
(32)優先日	1992年10月7日
(33)優先権主張国	欧州特許機構(E.P.)
(31)優先権主張番号	93307620.0
(32)優先日	1993年9月27日
(33)優先権主張国	欧州特許機構(E.P.)

(71)出願人 クエスト・インターナショナル・ビー・ブイ
オランダ国、1411・ジービー・ナードン、
ヒュイゼルストラートウェグ 28

(72)発明者 モーション、キース・ロバート
英国、ケント・シーティー18・8エイチエフ、
リミング、マウント・プレズント・クローズ 22

(72)発明者 ジャヌーセク、アンジェラ
英国、ケント、カンタベリー、ウッドローン・ウェイ 5エイ、ジュニパー・ハウス

(74)代理人 弁理士 山崎 行造 (外1名)

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 ジカルボン酸のヒドロキシアルキルアミド及びそれらの化粧用組成物における用途

(57) 【要約】

示されている式を有する 1 群のシュードセラミドであつて、式中、R 1 は炭化水素基であり；R 2 ~ R 8 は各々独立に H 又は CH_3 であり；R 9 及び R 10 は各々独立に H 又は 24 個までの炭素原子を有する炭化水素基であり；X 1 及び X 2 は独立に H 又は OH であり；Y 1 及び Y 2 は H 又は OH であり、Y 1 及び Y 2 の少なくとも 1 方は OH であり；ここで、R 9 及び R 10 と結合している炭素原子 Z は存在しなくてもよく；そして R 7 及び Y 2 と結合している炭素原子 W は存在しなくてもよい、シュードセラミドが開示される。これらの、組成物、特に、皮膚、髪、又は爪への局所的な塗布に適する化粧用組成物における使用が見出だされる。

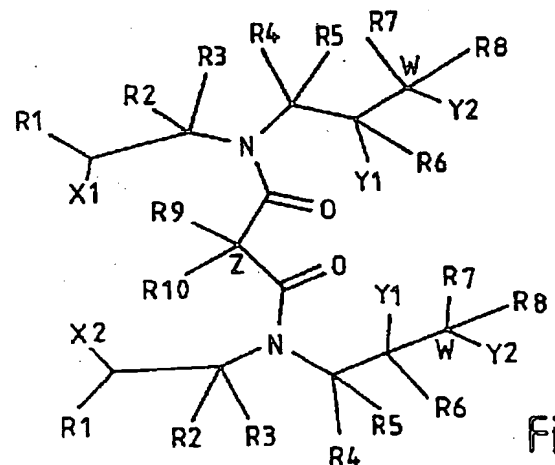


Fig. 2

【特許請求の範囲】

1. 図2によって示される式の化合物であって、式中：

R 1は炭化水素基であり；

R 2～R 8は各々独立にH又はCH₃であり；

R 9及びR 10は各々独立にH又は24個までの炭素原子を有する炭化水素基であり；

X 1及びX 2は独立にH又はOHであり；

Y 1及びY 2はH又はOHであり、Y 1及びY 2の少なくとも1方はOHであり；

ここで、R 9及びR 10と結合している炭素原子Zは存在しなくてもよく；そしてR 7及びY 2と結合している炭素原子Wは存在しなくてもよい、化合物。

2. R 1が脂肪族であり、好ましくは10～24個の炭素原子を有し、より好ましくは16～18個の炭素原子を有する、請求項1の化合物。

3. 図4に示す構造を有する、請求項1又は2の化合物。

4. 請求項1乃至3のいずれか1請求項の化合物を含む組成物、特に、皮膚、髪、又は爪への局所的な塗布に適する化粧用組成物。

5. 1種以上の請求項1、2、又は3の化合物を、0.0001乃至50重量%の範囲内を量、好ましくは0.001乃至20重量%の量、より好ましくは0.1乃至10重量%の量で含む、請求項4の組成物。

6. 前記化合物用の適切なキャリアビヒクルを含む、請求項4又は5の組成物。

7. 請求項4、5、又は6の組成物を含む密閉された容器。

8. 請求項1、2、又は3の化合物の、皮膚の水遮蔽性の修繕、爪の改善、及び／又は髪の改善用の薬剤としての使用。

9. 請求項4、5、又は6の組成物を局所的に塗布することを含む、皮膚、髪、又は爪の処理方法。

10. アルキルアミノアルコール／ジオール／トリオールを処理して対応するジアミドを製造することを含む、請求項1、2、又は3の化合物の製造方法。

【発明の詳細な説明】

ジカルボン酸のヒドロキシアルキルアミド及びそれらの化粧用組成物における

用途

発明の分野

本発明は化粧用組成物、特にいわゆる「シュードセラミド (pseudoceramides)」を含む化粧用組成物に関し、そして新規な群のシュードセラミドとそれらの皮膚、髪、及び爪のトリートメントにおける使用に関する。

発明の背景

セラミドは図 1 で示される式を有する 1 群の天然産の化合物であり、式中 $m = 10 \sim 16$ 及び $n = 12 \sim 24$ である。セラミド及びセラミド誘導体は、皮膚の水透過性において重要な役割を果たして、皮膚の構造の強度を増加させて水の損失を減少させ、それによって皮膚の状態を改善させると考えられており、セラミド及びセラミド誘導体をスキンケア組成物の成分として使用することは公知である。

シュードセラミドとして知られている、特定の非天然産のセラミドの変種が合成されるか又は提案されてきた。一般に、これらは、天然産の皮膚のセラミドのより安い代替物としてスキンケア組成物中で使用できるように、セラミドの特性に類似の特性を有し、皮膚に関するセラミドの挙動をまねるように設計される。

公知のシュードセラミドには、ロレアル (L'Oreal) の EP 0420722 A 及びユニリーバー (Unilever) の EP 0482860 A に記載されているものが含まれる。

本発明は、新規な群のシュードセラミドに基づくものである。

発明の要約

1 面において、本発明は、図 2 によって示される式の化合物を提供し、式中：

R 1 は炭化水素基であり；

R 2 ~ R 8 は各々独立に H 又は CH_3 であり；

R 9 及び R 10 は各々独立に H 又は 24 個までの炭素原子を有する炭化水素基であり；

X 1 及び X 2 は独立に H 又は OH であり；

Y 1 及び Y 2 は H 又は OH であり、Y 1 及び Y 2 の少なくとも 1 方は OH であ

り；

ここで、R 9 及び R 10 と結合している炭素原子 Z は存在しなくてもよく；そして R 7 及び Y 2 と結合している炭素原子 W は存在しなくてもよい。

本発明の化合物は、天然産の皮膚セラミドに類似の特定の性質を有しており、そのため新規な群のシュードセラミドを構成すると考えられる。

従って、本発明の化合物は皮膚、髪、及び爪のトリートメントにおける用途がある。

別の面において、本発明は、本発明の化合物を含む組成物、特に、皮膚、髪、又は爪への局所的な塗布に適する化粧用組成物を提供する。

また、本発明は、本発明による化合物の、皮膚の水遮蔽性の修繕、爪の改善、及び／又は髪の改善用の薬剤としての使用を含む。

本発明の組成物は1種以上の本発明の化合物を0.00001乃至50重量%の範囲内を量で有用に含み、0.001乃至20重量%が好ましく、0.1乃至10重量%がより好ましく、例えば、0.8乃至5.0重量%である。

組成物は、本発明の化合物用の適するキャリアビヒクルを含むのが好ましい。これは、一般に、本発明の化合物を皮膚、髪、又は爪の上に分散させ、その上でまんべんなく分配されるのを可能にする希釈剤、分散剤、又はキャリアとして作用する化粧品用として認められているビヒクルである。

適するキャリアビヒクルには、水、液体又は固体の皮膚軟化剤、溶媒、保湿剤、及び粉末が含まれる。単独で又は混合物として使用できる、これらの種類のビヒクルはEP 0482860 Aに与えられている。

キャリアビヒクルは通常組成物の10乃至99.9重量%を構成し、好ましくは50乃至90重量%であり、その他の化粧品添加剤が存在しない場合組成物の残り全てを構成できる。

選択的な皮膚によい物質及び化粧品添加剤も含まれてよい。

本発明の化合物は、優れた乳化、ゲル化、及び増粘特性を有し、粘稠なエマルジョン又はゲルの形態の組成物において使用するのに適している。

本発明の組成物の特に有用な形態はエマルジョンであり、この場合、通常油又は油性物質が（必要に応じて）乳化剤とともに存在して、主に使用される乳化剤

の平均の親水性-親油性バランス (HLB) に依存して、油中水型エマルジョンか又は水中油型エマルジョンを与える。

本発明の組成物は、所望により、1種以上の油又は油の性質を有するその他の物質を含むことができる。

適する油の例には、鉱油及び植物性油、及び油性物質、例えば、EP 0482860 A 中において皮膚軟化剤として既に提案されているようなものが含まれる。その他の油及び油性物質には、ポリジメチルシロキサンのような、揮発性及び非揮発性のシリコーン油が含まれる。

エマルジョンを形成する目的で存在する場合、油又は油性は通常組成物の90体積%までを構成し、好ましくは10~80体積%を構成する。

本発明による組成物は、所望により、1種以上の乳化剤も含むことができ、その選択が通常油中水型エマルジョンが形成されるか又は水中油型エマルジョンが形成されるかを決定する。

油中水型エマルジョンが要求される場合、選択される1種以上の乳化剤は1~8の平均HLB値を有していなければならない。水中油型エマルジョンが要求される場合、選択される1種以上の乳化剤は8より大きい平均HLB値を有していなければならない。

適する乳化剤の例はEP 0482860 A中に与えられている。

所望により、2種以上のエマルジョンが使用できることは理解されるべきである。

乳化剤を配合することが適当である場合、本発明の組成物に配合される乳化剤又はそれらの混合物の量は、典型的には、組成物の1~50重量%であり、好ましくは2~20重量%であり、より好ましくは2~10重量%である。

また、本発明の組成物は水を、通常98体積%まで、好ましくは5~80体積%含むことができる。

本発明の組成物は、所望により、上述の選択的乳化剤の代わりにか又はそれらに追加して、乳化剤としても作用することができる高分子量シリコーン界面活性剤も含むことができる。このシリコーン界面活性剤は、典型的には、EP 0482860 A中に開示されているように、ポリオキシエチレン及び／又はポリオキシポリエ

チレン側鎖を有するジメチルポリシロキサン的高分子量ポリマーである。

この組成物は、例えば、皮膚及び爪用のクリーム及びローション、日焼け用製品、石鹸、浴用オイル、ローション、及びフォーム、シャンプー、ヘアコンディショナー、その他のような様々な形態を取ることができる。

本発明の組成物は、例えば、4,000~10,000 mPasの粘度を有するローション、10,000~20,000 mPasの粘度を有する液体クリーム、又は20,000~100,000 mPas 或いはそれ以上の粘度を有するクリームとして配合できる。本発明の組成物は、その粘度と消費者による意図された用途に対して適する容器中に包装できる。

例えば、ローション又は液体クリームは、瓶、ロールボールアプリケーション、プロペラント駆動エアゾル装置(propellant-driven aerosol device)、又は指で操作するのに適するポンプを備えた容器中に包装することができる。組成物がクリームである場合、非変形性の瓶、チューブのような絞り容器、又は蓋付広口瓶(lidded jar)中で簡単に保存できる。

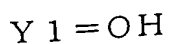
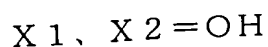
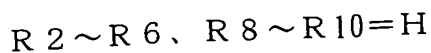
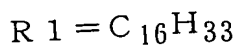
従って、本発明は、本発明の組成物を含有する密閉容器も提供する。

さらに別の面において、本発明は、本発明の組成物を局所的に塗布することを含む、皮膚、髪、又は爪の処理方法も提供する。

ここで本発明の化合物を検討すると、R 1は脂肪族であるのが好ましく、10~24個の炭素原子を有するのが好ましく、10~18個の炭素原子を有するのがより好ましい。

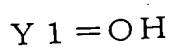
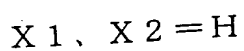
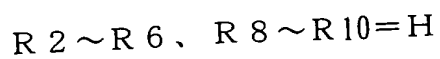
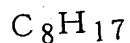
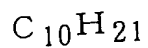
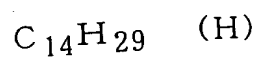
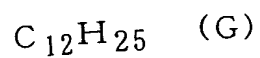
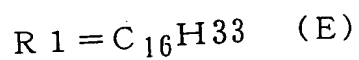
合成された一般式の範囲内に入る化合物の例は図3~9に示されている。

図3の化合物は本明細書中においてシュードセラミドIと呼ぶが、この化合物中において：



W、Y 2、及びR 7は存在しない。

図4の化合物は3種類の化合物を含み、これらは本明細書中においてそれぞれシュードセラミドE、G、及びHと呼ばれる。これらの化合物において：



W、Y 2、及びR 7は存在しない。

図5の化合物において：

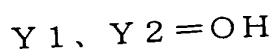
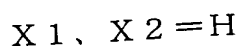
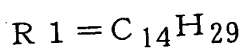
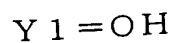
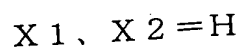
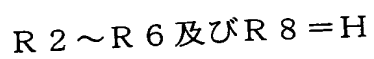
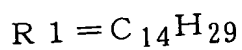


図6の化合物において：



W、Y 2、及びR 7は存在しない。

Z、R 9 及びR 10は存在しない。

図7の化合物において：

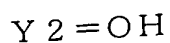
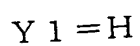
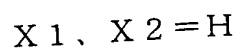
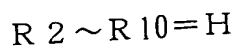
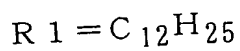


図8の化合物において：

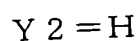
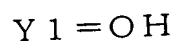
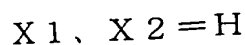
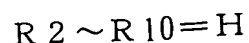
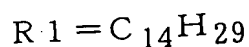
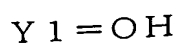
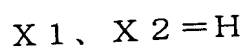
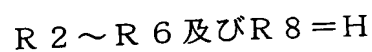
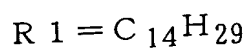
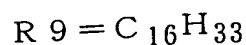


図9の化合物は本明細書中において化合物10と呼ばれるが、この化合物において:



W、Y₂、及びR₇は存在しない。



R₁₀は存在しない。

皮膚のトリートメントの目的に現在のところ好ましい化合物はシュードセラミドEとシュードセラミドHである。

これらの化合物は対応するアルキルアミノアルコール／ジオール／トリオール処理してジアミドを製造することによって、例えば、酸塩化物法のジエステル法を使用することによって、簡便に調製することができる。当業者に公知のアミドの調製の標準的方法が存在する。関連するアルキルアミノアルコール／ジオール／トリオールは、例えば、Bull. Chim. Soc. Fr. (1943)、10、347に記載されているような、公知の方法を使用して調製できる。

もう1つの面において、本発明は、本発明の化合物の調製方法であって、アルキルアミノアルコール／ジオール／トリオールを処理して対応するジアミドを製

造することを含む方法を提供する。

図面の簡単な説明

図1はセラミドの式を示す。

図2は本発明の化合物の一般式を示す。

図3～9は本発明の特定の化合物の式を示す。

本発明は以下の実施例中において例示によりさらに説明される。

実施例1

図4に示す式のシュードセラミドH（商標名 クエスタミドH (Questamide H) としても知られている）を以下のようにして調製した。

N-ヘキサデシル-2-アミノエタノールをBull. Chim. Soc. Fr. (1943)、10、347に記載されている方法によって調製した。

対応するジアミドを以下のようにしてジエステル法によって調製した。

N-ヘキサデシル-2-アミノエタノール（0.06モル）とシクロヘキサン（300 ml）を、滴下ロート、オーバーヘッド攪拌機、及び凝縮器付きディーンスターク (Dean-Stark) 装置を備えた500 mlの反応フラスコに入れた。混合物を攪拌しながら加熱して還流させ、ジメチルマロネート（0.03モル）を10分間にわたって添加した。攪拌と加熱をメタノールが発生しなくなるまで続けた。反応混合物を冷却し、濾過してジアミドを得た（13.2g、69%の収率）。

コレステロールのような細胞間脂質及び脂肪酸と組み合わせると、シュードセラミドHは、天然のセラミドによって形成されたのと類似の「構造化 (structured)」液晶を形成した。また、シュードセラミドHは天然のセラミドと同様にスクアレンとともにゲル様構造を形成した。

実施例2

図9で示される式の化合物10を以下のようにして調製した。

N-2-ヒドロキシエチルセチルアミン（20g、0.070モル）、ジメチルヘキサデシルマロネート（13.5g、0.035モル）、及びシクロヘキサン（100 ml）を、ディーンスターク分岐 (Dean-Stark take off) を備えた250 mlの反応フラスコに入れた。混合物を加熱しながら攪拌して190時間還流させた。溶媒を真空中で除去すると、純白ではない固体残渣が残った。これをジクロロメタンから再結晶

化させ、乾燥して、融点50～51℃の化合物10を得た。IRとNMRスペクトルは図9の構造を支持した。

実施例3

特に乾燥した皮膚上での使用に適する化粧用スキンクリーム組成物を以下の成分から製造した。

<u>CTFA名</u>	<u>成分</u>	<u>重量%</u>
<u>A相</u>		
カルボマー (Carbomer)	Carbopol 940	0.34
プロピレングリコール		3.45
メチルジブロモグルタロニトリル		
及びフェノキシエタノール	Euxyl K400	0.10
トリエタノールアミン		1.62
脱イオン水		100.00まで
<u>B相</u>		
セテアレス (Ceteareth)-25	Cremaphor A25	1.30
グリセリルステアレート及び		
PEG-100 ステアレート	Arlacel 165	3.25
ステアリン酸		1.30
イソプロピルミリステート	Estol IMP	5.00
カプリン/カプリルトリグリセリド	Estol GTCC	7.00
プロピレングリコールジカプリレート/		
ジカプレート	Estol PDCC	4.00
大豆ステロール	Generol 122	0.50
ミリスチン酸		0.50
ヒドロキシセタミド	Questamide H	1.00
香料	Quest	0.20

ヒドロキシセタミド (Hydroxycetamide) は Questamide H (即ち、シュードセラミド H) の提案された CTFA 名である。

カルボマーを水中で混合し分散させ、その後 A 相の残りの成分を添加した。B 相の成分を混合した。A 相と B 相をそれぞれ 80℃ まで加熱した。剪断を加えながら、B 相を A 相に添加した。均一混合物が生成した後、冷えるまで混合物を攪

拌した。

このようにして、皮膚への局所的な塗布に適するpH 7.5の均一クリームを製造した。

実施例4

化粧用スキนครリーム組成物を以下の成分から製造した。

<u>CFTA名</u>	<u>商標名</u>	<u>%w/w</u>
<u>A相</u>		
カルボマー	Carbopol 980	0.20
プロピレングリコール		3.45
トリエタノールアミン		0.20
脱イオン水		100.00まで
<u>B相</u>		
セテアレスー6 ステアリルアルコール	Cremaphor A6	1.00
セテアレスー25	Cremaphor A25	1.00
ステアリン酸		0.80
カプリン/カプリルトリグリセリド	Myglyol 812	4.25
ジメチコン (Dimethicone)	Silicone 200/350	0.80
セチルアルコール		0.80
鉱油		2.00
大豆ステロール	Generol 122	0.60
ヒドロキシセタミド	Questamide H	0.80
<u>C相</u>		
メチルジブロモグルタロニトリル	Euxyl K400	0.10
及びフェノキシエタノール		
香料	Quest	0.20

A相の成分を剪断しながら混合した。B層の成分を混合した。A相とB相をそれぞれ80℃まで加熱した。剪断を加えながら、B相をA相にゆっくりと添加した。混合物を45℃まで冷却した。C相の成分と一緒に混合して、その後、A相とB

相の冷却された混合物 (45℃) に添加し、冷えるまで攪拌した。

このようにして、皮膚への局所的な塗布に適する pH 6.3 の均一な軽い白色クリームを製造した。

実施例 5

化粧用スキンクリーム組成物を以下の成分から製造した。

<u>C F T A 名</u>	<u>商標名</u>	<u>% w/w</u>
<u>A 相</u>		
カルボマー	Carbopol 940	0.22
プロピレングリコール		4.00
メチルパラベン	Nipagin M	0.20
脱イオン水		100.00まで
<u>B 相</u>		
スクアレン	Prisorine SQV	6.50
鉱油		3.00
セチルアルコール		0.50
グリセリルステアレート (NSE)	Estol	3.25
ジメチコン	DC 200/350	0.80
ラノリンアルコール	Super Hartolan	1.00
グリセリルステアレート及び	Lexemul 561	3.25
PEG-100ステアレート		0.10
プロピルパラベン		3.25
商標付き乳化ワックス	Polawax	3.10
イソプロピルミリステート	Estol IPM	0.25
ミリスチン酸		0.35
大豆ステロール	Generol 122	4.00
オクチルパルミテート	Estol EHP	2.00
ヒドロキシセタミド	Questamide H	
<u>C 相</u>		

トリエタノールアミン		0.38
脱イオン水		1.00
香料	Quest	0.25
D相		
イミダゾリジニル尿素	Germall 115	0.20
脱イオン水		3.00

A相の成分を剪断しながら混合した。B層の成分を混合した。A相とB相をそれぞれ80℃まで加熱した。剪断を加えながら、B相をA相にゆっくりと添加した。混合物を45℃まで冷却した。C相の成分を別々にA相とB相の冷却された混合物(45℃)に添加した。D相の成分を混合し、A、B、及びC相の混合物に添加し、冷えるまで攪拌した。

このようにして、皮膚への局所的な塗布に適するpH5.8の均一な十分に形状を備えた光沢のあるクリームを製造した。

実施例 6

水中油型エマルジョンを以下の成分から製造した。

CFTA名	商標名	重量%	
		バッチ 1	バッチ 2
A相		100.00まで	100.00まで
水			
メチルパラベン	Nipagin M	0.20	0.20
ポリアクリルアミド	Sepigel 305	1.00	1.00
及びC13-14			
イソパラフィン及びラウレス (Laureth) 7			
B相			
セチルアルコール		3.00	3.00
スクアレン		2.84	2.84
プロピルパラベン	Nipasol M	0.15	0.15
ペンタエリスリトールテトラ	Crodamol PTC	2.83	2.83

カプレートーカブリレート			
ジイソアラキジルジリノレート	Liquiwax DIEFA	2.83	2.83
セテアレス-20	Empilan KM20	3.00	3.00
ジメチコン	Silicone	0.50	0.50
	200/350		
ヒドロキシセタミド	Questamide H	—	2.00
C相			
水		2.00	2.00
イミダゾリジニル尿素	Germal 115	0.15	0.15
	pH	6.80	6.80

Sepigel 305をA相の冷水中に分散するまで攪拌することによってエマルジョンを調製した。その後、A相の残りの成分を添加した。B層の成分を混合した。A相とB相をそれぞれ80℃まで加熱した。剪断を加えながら、B相をA相に添加した。均一混合物が生成した後、冷えるまで混合物を攪拌した。C相の成分を一緒に混合して、その後、A相とB相の冷却された混合物に添加し、さらに混合した。

ヘリオパス (heliopathe) を使用する粘度計UKマシーン (Viscometers UKmachine)、ERV-8型で、バッチ1及び2の粘度を試験した。結果は以下の通りである。

	バッチ 1	バッチ 2
T-バー (T-Bar)	B	B
速度	10	10
CPS	2080	18160

これらの結果は、2.00%のシュードセラミドHを含むバッチ2が、シュードセラミドHを含まないバッチ1よりも、ずっと高い粘度を有していることを示している。

実施例 7

水中油型エマルジョンを以下の成分から製造した。

重量%

<u>CFTA名</u>	<u>商標名</u>	<u>バッチ 1</u>	<u>バッチ 2</u>
<u>A相</u>		100.00まで	100.00まで
水			
メチルパラベン	Nipagin M	0.20	0.20
<u>B相</u>			
アボカド油		2.00	2.00
イソプロピルミリステート		7.00	7.00
セチルアルコール		0.50	0.50
セテアレス-20	Empilan KM20	1.00	1.00
ジメチコン	Silicone	1.00	1.00
	200/350		
プロピルパラベン	Nipasol M	0.10	0.10
ヒドロキシセタミド	Questamide H	—	2.00
<u>C相</u>			
水		2.00	2.00
イミダゾリジニル尿素	Germal 115	0.15	0.15
	pH	7.40	7.10

A相及びB相の成分を別個に混合し、2つの混合物を70℃まで加熱することによってエマルジョンを調製した。剪断を加えながら、B相をA相に添加した。均一混合物が生成した後、冷えるまで混合物を攪拌した。

粘度計UKマシン、ERV-8型で、バッチ1及び2の粘度を試験した。結果は以下の通りである。

	<u>バッチ 1</u>	<u>バッチ 2</u>
スピンドル	R3	R3
速度	10	10
CPS	30	7230

これらの結果は、2.00%のシュードセラミドHを含むバッチ2が、シュードセラミドHを含まないバッチ1よりも、ずっと高い粘度を有していることを示して

いる。

【図1】

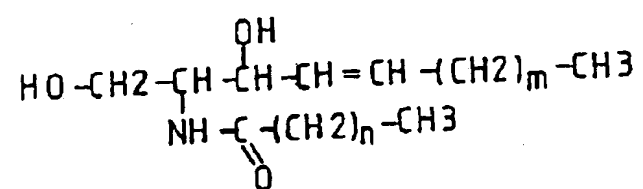


Fig. 1

【図2】

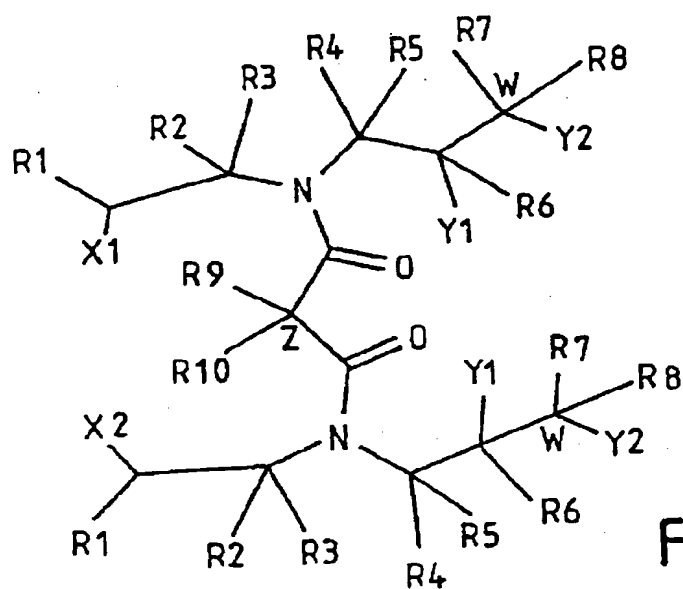


Fig. 2

【図3】

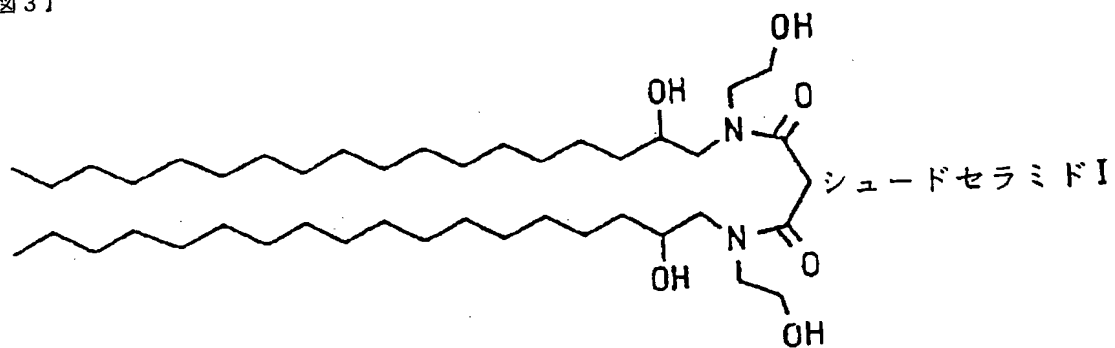


Fig. 3

【図4】

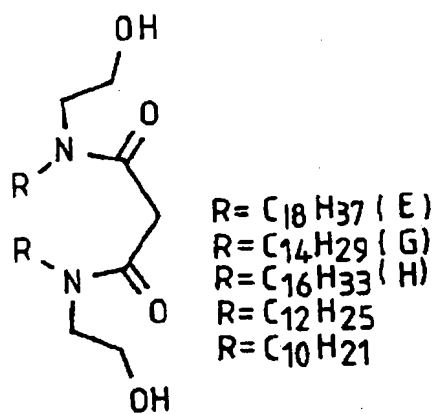


Fig. 4

【図5】

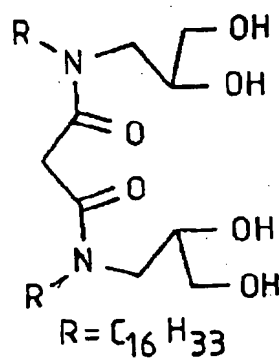


Fig. 5

【図 6】

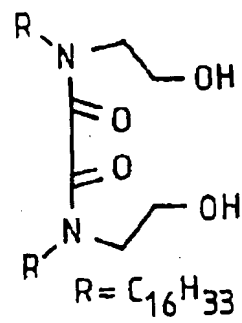


Fig. 6

【図 7】

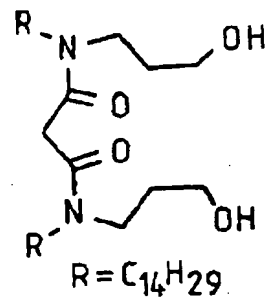


Fig. 7

【図 8】

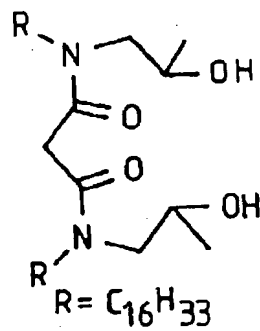


Fig. 8

【図9】

化 合 物 10

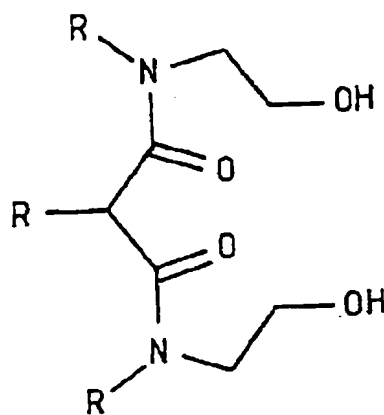
10: R = $n\text{-C}_{16}\text{H}_{33}$

Fig. 9

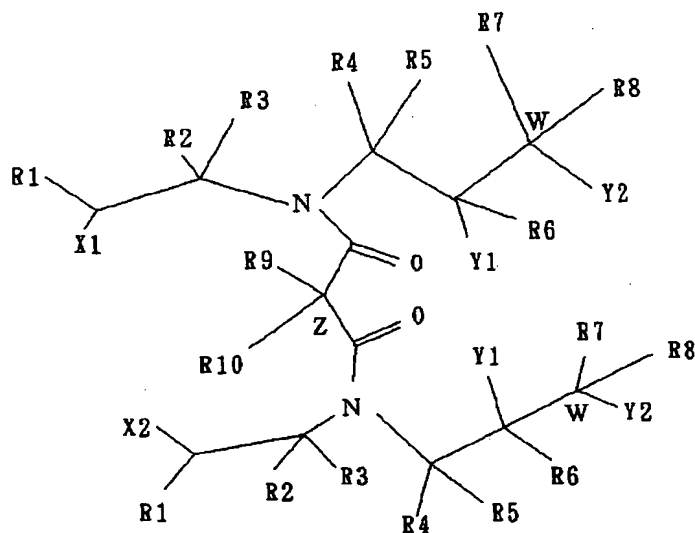
【手続補正書】特許法第184条の8

【提出日】1994年9月27日

【補正内容】

請求の範囲

1. 一般式：



の化合物であって、式中：

R1は10～24個の炭素原子を有する脂肪族炭化水素基であり；

R2～R8は各々独立にH又はCH₃であり；

R9及びR10は各々独立にH又は24個までの炭素原子を有する炭化水素基であり；

X1及びX2は独立にH又はOHであり；

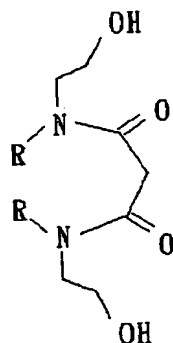
Y1及びY2は独立してH又はOHであり、Y1及びY2の少なくとも1方はOHであり；

ここで、R9及びR10と結合している炭素原子Zは存在しなくてもよく；そしてR7及びY2と結合している炭素原子Wは存在しなくてもよい、化合物。

2. R1が16～18個の炭素原子を有する、請求項1の化合物。

3. $-C(R_4R_5)-C(Y_1R_6)-C(R_7R_8Y_2)$ 基が、CH₂-C(H₂OH)、CH₂-CHOH-CH₂OH、CH₂-CH₂-CH₂OH、又はCH₂-CHOH-CH₃である、請求項1の化合物。

4. R₉ 及び R₁₀ と結合している炭素原子 Z が CH₂ である、請求項 1 乃至 3 のいずれか 1 請求項の化合物。
5. R₉ 及び R₁₀ のうち的一方が 24 個までの炭素原子を有する脂肪族炭化水素基であり、他方が H である、請求項 1 乃至 3 のいずれか 1 請求項の化合物。
6. 式：



- を有し、式中、R は 10 ～ 18 個の炭素原子を有する、請求項 4 の化合物。
7. R₂ 及び R₃ の両方が水素であり、X₁ 及び X₂ の両方が OH である、請求項 3 の化合物。
8. 請求項 1 乃至 7 のいずれか 1 請求項の化合物の 1 種以上及びキャリアビヒクルを含む、皮膚、髪、又は爪への局所的な塗布に適する化粧用組成物。
9. 請求項 1 乃至 7 のいずれか 1 請求項の化合物が 0.0001 乃至 50 重量% の量で存在する、請求項 8 の組成物。
10. 請求項 1 乃至 7 のいずれか 1 請求項の化合物の、皮膚の水遮蔽性の修繕、爪の改善、又は髪の改善のための使用。
11. 請求項 8 又は 9 の組成物を局所的に塗布することを含む、皮膚、髪、又は爪の処理方法。

【國際調查報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Intern. Application No.
PCT/GB 93/02061A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 5 C07C233/18 A61K7/48

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 5 C07C A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DE, A, 26 04 554 (HENKEL UND CIE. G.M.B.H.) 11 August 1977	1
Y	see claims see page 8; example A see page 9 - page 10; example B7	2-10
A	JAOCS, J. AM. OIL CHEM. SOC., 65(5), 820-5 1988 MICICH, T. J. ET AL. 'Wetting properties of nonionics from branched fatty diamides' see page 822, left column, paragraph 2 see page 822; table 1	1
A	EP, A, 0 450 527 (KAO CORPORATION) 9 October 1991 see claims	1-10

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- * "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- * "E" earlier document but published on or after the international filing date
- * "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- * "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- * "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

* "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

* "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

* "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

* "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

14 December 1993

Date of mailing of the international search report

29. 12. 93

Name and mailing address of the ISA
European Patent Office, P.B. 2100 Patentstrasse 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 spo nl
Fax (+ 31-70) 340-3016

Authorized officer

Pauwels, G

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

C(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		International Application No. PCT/GB 93/02061
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP,A,0 482 860 (UNILEVER NV.) 29 April 1992 cited in the application see claims	1-10
Y	EP,A,0 420 722 (L'ORÉAL) 3 April 1991 cited in the application see claims	2-10

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

information on patent family members

International Application No
PCT/GB 93/02061

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
DE-A-2604554	11-08-77	NONE	
EP-A-0450527	09-10-91	JP-A- 4009309 JP-A- 4211640	14-01-92 03-08-92
EP-A-0482860	29-04-92	AU-B- 639373 AU-A- 8600291 JP-A- 4282304 US-A- 5198210	22-07-93 30-04-92 07-10-92 30-03-93
EP-A-0420722	03-04-91	FR-A- 2652002 CA-A- 2025790 JP-A- 3193754 US-A- 5149860 US-A- 5198470	22-03-91 22-03-91 23-08-91 22-09-92 30-03-93

フロントページの続き

(81) 指定国 EP(AT, BE, CH, DE,
DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, M
C, NL, PT, SE), OA(BF, BJ, CF, CG
, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN,
TD, TG), AT, AU, BB, BG, BR, BY,
CA, CH, CZ, DE, DK, ES, FI, GB, H
U, JP, KP, KR, KZ, LK, LU, MG, MN
, MW, NL, NO, NZ, PL, PT, RO, RU,
SD, SE, SK, UA, US, VN

(72) 発明者 ワトキンス、スティーブン
英国、ケント、アシュフォード、シャロッ
ク、キルン・クローズ 7

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☐ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.